

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2003-048878

(43)Date of publication of application : 21.02.2003

---

(51)Int.Cl.

C07D207/456  
A01N 43/08  
A01N 43/10  
A01N 43/36  
A01N 43/40  
A01N 43/54  
A01N 43/56  
A01N 43/78  
A01N 43/80  
A01N 43/828  
C07C211/52  
C07D213/81  
C07D213/82  
C07D231/14  
C07D239/28  
C07D261/18  
C07D275/03  
C07D277/56  
C07D285/06  
C07D307/68  
C07D333/38  
C07D333/40

---

(21)Application number : 2002-157757

(71)Applicant : NIPPON NOHYAKU CO LTD

(22)Date of filing : 30.05.2002

(72)Inventor : FURUYA TAKASHI  
YAMAGUCHI MINORU  
TONISHI MASANORI  
SEO AKIRA  
MORIMOTO MASAYUKI  
TAKEMOTO TAKESHI  
FUJIOKA NOBUSUKE

---

(30)Priority

Priority number : 2001164787    Priority date : 31.05.2001    Priority country : JP

---

(54) SUBSTITUTED ANILIDE DERIVATIVE, ITS INTERMEDIATE, AGRICULTURAL  
HORTICULTURAL CHEMICAL AND USAGE OF THE SAME

(57)Abstract:

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号  
特開2003-48878  
(P2003-48878A)

(43) 公開日 平成15年2月21日 (2003.2.21)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テマコード* (参考)
C 0 7 D 207/456		C 0 7 D 207/456	4 C 0 2 3
A 0 1 N 43/08		A 0 1 N 43/08	B 4 C 0 3 3
	43/10	43/10	Z 4 C 0 3 6
			B 4 C 0 3 7
			Z 4 C 0 5 5

審査請求 未請求 請求項の数 8 O L (全 42 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2002-157757 (P2002-157757)  
(22) 出願日 平成14年5月30日 (2002.5.30)  
(31) 優先権主張番号 特願2001-164787 (P2001-164787)  
(32) 優先日 平成13年5月31日 (2001.5.31)  
(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000232623  
日本農薬株式会社  
東京都中央区日本橋1丁目2番5号  
(72) 発明者 古谷 敬  
大阪府泉佐野市日根野2821-1  
(72) 発明者 山口 実  
大阪府大阪狭山市池尻自由丘1-4-3-402  
(72) 発明者 遠西 正範  
大阪府堺市福田1040-1-408  
(74) 代理人 100068618  
弁理士 萼 経夫 (外2名)

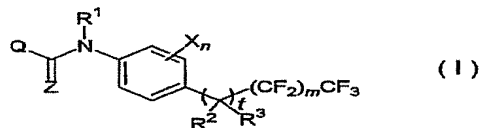
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 置換アニリド誘導体、その中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法

(57) 【要約】

【解決手段】 (I)

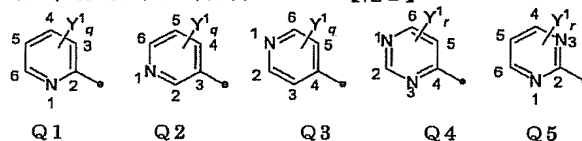
【化1】



(式中、R<sup>1</sup> はH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカ

ルボニル、(置換)フェニル等、R<sup>2</sup> はH、ハロゲン、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、R<sup>3</sup>はH、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、OH、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ、(置換)フェノキシ、(置換)フェニルチオ、(置換)フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ等、Xはハロゲン、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、(置換)フェニル、(置換)複素環等、tは0~1、mは0~6、nは1~4、ZはO、S、QはQ1~Q5等、

【化2】

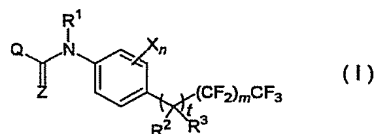


(式中、Y<sup>1</sup> はハロゲン、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、(置換)フェニル、(置換)複素環等、qは0~2、rは0~3)の置換アニリド誘導体、農園芸用薬

剤、その使用方法。

【効果】 本発明の化合物は優れた殺虫、殺ダニ、殺菌作用を示す。

【化 1】



{式中、 $R^1$  は水素原子、 $C_1-C_6$  アルキル基、ハロゲンアルキル基、 $C_1-C_6$  アルキルカルボニル基、ハロゲンアルキルカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$  アルキル基、ハロゲンアルキル基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、ハロゲンアルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ基、ハロゲンアルキルチオ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロゲンアルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、ハロゲンアルキルスルホニル基、モノ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。 $R^2$  は水素原子、ハロゲン原子又はハロゲンアルキル基を示す。 $R^3$  は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1-C_6$  アルキル基、ハロゲンアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、ハロゲンアルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルコキシシ/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、ハロゲンアルコキシシ/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、ハロゲンアルキルチオ/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルフィニル/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、ハロゲンアルキルスルフィニル/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、ハロゲンアルキルスルホニル/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、モノ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、同一又は異なっても良いジ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ/ $C_1-C_3$  アルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ基、ハロゲンアルキルチオ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロゲンアルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、ハロゲンアルキルスルホニル基、アミノ基、モノ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$  アルキル基、ハロゲンアルキル基、 $C_1-C_6$  アルコキシ基、ハロゲンアルコキシ基、 $C_1-C_6$  アルキルチオ基、ハロゲンアルキルチオ基、 $C_1-C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロゲンアルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$  アルキルスルホニル基、ハロゲンアルキルスルホニル基、モノ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ/ $C_1-C_6$  アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$  アルキル基、ハロゲンアルキル基、 $C_1-C_6$  アルコキシ

基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基を示す。tは0または1を示し、mは0～6の整数を示す。tが0のとき、Xは同一又は異なっても良く、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基を示し、nは1～4の整数を示す。tが1のとき、Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル

基、 $C_1-C_8$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_8$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $C_1-C_8$ アルキルカルボニル基、ハロ $C_1-C_8$ アルキルカルボニル基、 $C_1-C_8$ アルキルチオカルボニル基、ハロ $C_1-C_8$ アルキルチオカルボニル基、 $C_1-C_6$ アルキルカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオカルボニル $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル $C_1-C_6$ アルキル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ $C_1-C_6$ アルキル基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ $C_1-C_6$ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ

基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、 $n$ は1~4の整数を示す。又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1-C_6$ アルキル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキル基、 $C_1-C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1-C_6$ アルコキシ基、 $C_1-C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルチオ基、 $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1-C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1-C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1-C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1-C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、Xは $R^1$ と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~8員環を形成することができる。Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。QはQ1~Q25で表される置換基を示す。

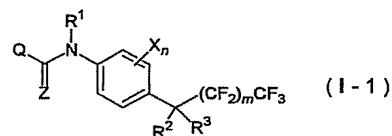
【化2】



キルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル  
 スルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C  
 1-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホ  
 ニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっ  
 ても良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、フェニル基、同一  
 又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ  
 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア  
 ルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチ  
 オ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフ  
 ィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
 キルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル  
 基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても  
 良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカル  
 ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フ  
 ェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハ  
 ロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、  
 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
 アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
 ルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
 キルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、  
 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルア  
 ミノ基、同一又は異なっても良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミ  
 ノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される  
 1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又  
 は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ  
 基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル  
 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C  
 6アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア  
 ルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニ  
 ル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
 ルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は  
 異なっても良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
 コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有  
 する置換複素環基を示す。Y<sup>3</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
 ル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基又は同一若し  
 くは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ  
 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア  
 ルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチ  
 オ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフ  
 ィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア  
 ルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル  
 基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても  
 良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカル  
 ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フ  
 ェニル基を示す。pは0~2の整数を示し、qは0~4  
 の整数を示し、rは0~3の整数を示す。)を示す。}  
 で表される置換アニリド誘導体。

【請求項2】 一般式(I-1)

【化3】

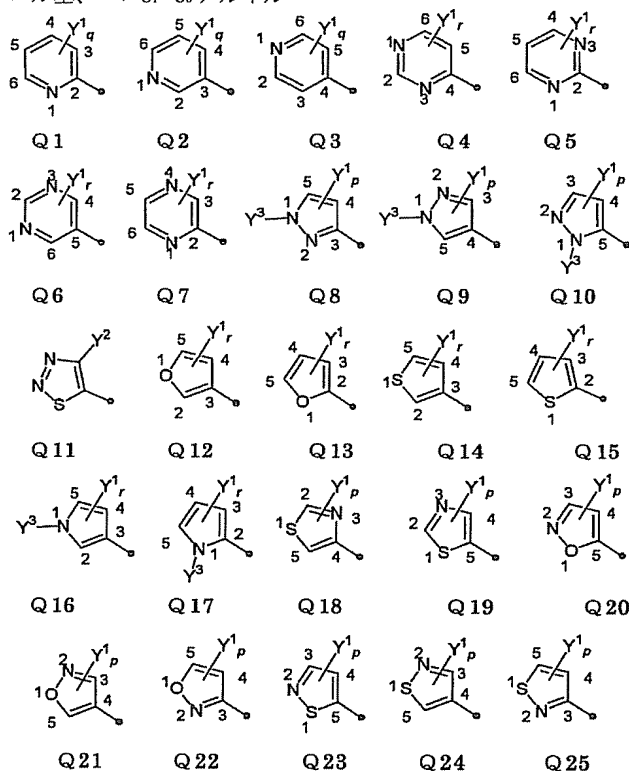


(式中、R<sup>1</sup> は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
 アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
 アルキルカルボニル基を示す。R<sup>2</sup>は水素原子、ハロゲ  
 ン原子又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基を示す。R<sup>3</sup>は水素原  
 子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
 ル基、シアノ基、ヒドロキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、  
 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコ  
 キシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C  
 6アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル  
 チオC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>-C  
 3アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコ  
 キシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ  
 基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ基、同一  
 又は異なっても良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコ  
 キシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ  
 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル  
 スルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC  
 1-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基を示す。mは0~6の整数を  
 示す。Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シ  
 アノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C  
 8アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキ  
 ニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル  
 基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アル  
 コキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ  
 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスル  
 ホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異な  
 っても良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキルカル  
 ボニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アル  
 キルチオカルボニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキルチオカルボ  
 ニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、  
 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
 アルキルチオカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア  
 ルキルチオカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキ  
 シC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ  
 ル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
 キルスルフィニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスル  
 ホニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C  
 6アルキル基、同一又は異なっても良いC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル  
 アミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基又は同一若しくは  
 異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコ  
 キシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ  
 基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィ  
 ニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル  
 キルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、  
 50

キルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、nは1~4の整数を示す。又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル

スルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、XはR<sup>1</sup>と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~8員環を形成することができる。Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。QはQ1~Q25で表される置換基を示す。

## 【化4】



(式中、Y<sup>1</sup>は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスル

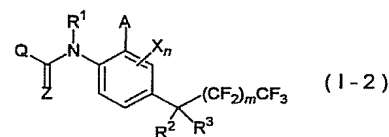
フィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ

基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、芳香環上の隣接した2個の $Y^1$ は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。 $Y^2$ は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アル

ルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。 $Y^3$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。 $p$ は0~2の整数を示し、 $q$ は0~4の整数を示し、 $r$ は0~3の整数を示す。)を示す。)で表される置換アニリド誘導体。

【請求項3】 一般式(I-2)

【化5】



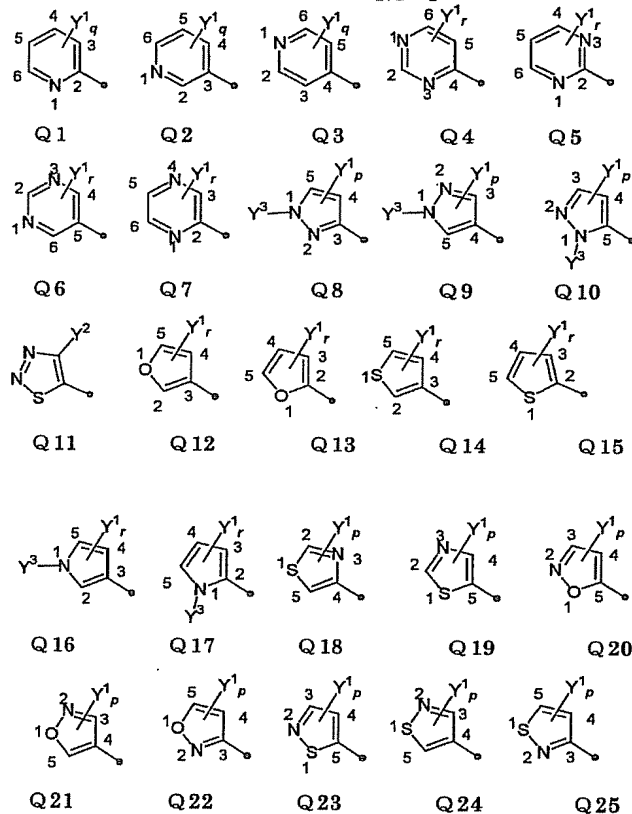
(式中、 $R^1$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基を示す。 $R^2$ は水素原子、ハロゲン原子又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基を示す。 $R^3$ は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシアルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシアルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオアルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニルアルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニルアルコキシ基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノアルコキシ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノアルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基を示す。 $m$ は0~6の整数を示す。 $A$ は $C_3$ - $C_8$ アルキル基、ハロ $C_3$ - $C_8$ アルキル基、 $C_3$ - $C_8$ アルケニル基、ハロ $C_3$ - $C_8$ アルケニル基、 $C_3$ - $C_8$ アルキニル基、ハロ $C_3$ - $C_8$ アルキニル基、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル $C_1$ - $C_6$ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アル



キルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボ

ニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基又は同一若しくは異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基を示し、nは0~3の整数を示す。Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。QはQ1~Q25で表される置換基を示す。

## 【化6】



(式中、Y<sup>1</sup>は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル

ルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル

10

20

30

40

【請求項8】 一般式(II)

$$\text{HN}(\text{R}^1)-\text{C}_6\text{H}_4(\text{X})_n-\text{C}(\text{R}^2)(\text{R}^3)-\text{C}(\text{CF}_2)_m\text{CF}_3 \quad (\text{II})$$

(式中、R<sup>1</sup> は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>

50

ノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基を示す。tは1を示し、mは0から6の整数を示す。Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択さ

れる 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、 $n$  は 1~4 の整数を示す。又、芳香環上の隣接した 2 個の  $X$  は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有することもできる。) で表される置換アニリン誘導体。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は置換アニリド誘導体、その中間体及び該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤、殺菌剤又は殺ダニ剤並びにその使用方法に関するものである。

【0002】

【従来技術】特開平 5-221994 号公報や、特開平 10-251240 号公報に本発明の置換アニリド誘導体に類似した化合物が農園芸用殺菌剤として有用であることが記載されている。

【0003】

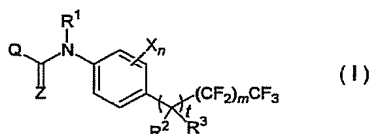
【発明が解決しようとする課題】農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。又、就農者の高齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用薬剤の創出が求められている。

【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者等は新規な農園芸用薬剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式 (II) で表される置換アニリン誘導体が文献未記載の新規化合物であり、該化合物は医薬、農薬等の生理活性を有する各種誘導体を製造する上で有用な中間体であることを見だし、更に該化合物から誘導される一般式 (I) で表される置換アニリド誘導体が文献未記載の新規化合物であり、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫、殺菌又は殺ダニ剤として有用であることを見だし、本発明を完成させたものである。

【0005】即ち、本発明は一般式 (I)

【化 8】



【式中、 $R^1$  は水素原子、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルカルボニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

【0006】 $R^2$  は水素原子、ハロゲン原子又はハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基を示す。 $R^3$  は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、モノ  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、同一又は異なっても良い  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ  $C_1$ - $C_3$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基、フェノキシ基、

【0007】同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキル基、 $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、ハロ  $C_1$ - $C_6$  アルキルスルホニル基、モノ  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い  $C_1$ - $C_6$  アルキルアミノ基又は  $C_1$ - $C_6$  アルコキシカルボニル基か

ル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル  
チオカルボニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキルチオカルボニル

基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、

【0010】フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換

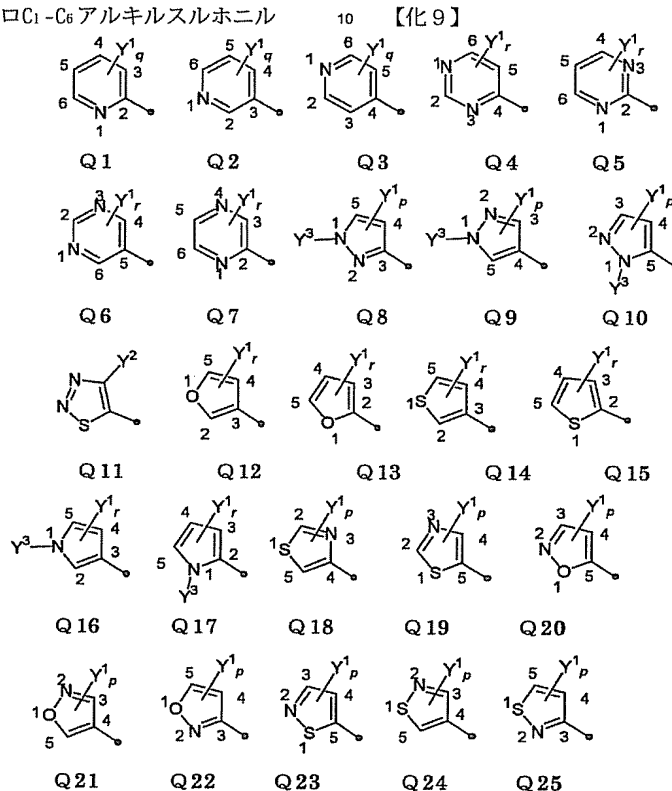
基を有する置換複素環基を示し、 $n$ は1～4の整数を示す。

【0011】又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル

基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、Xは $R^1$ と結合して、1～2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5～8員環を形成することができる。Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

【0012】QはQ1～Q25で表される置換基を示す。

【化9】



(式中、 $Y^1$ は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル基、ハロ $C_2$ - $C_6$ アルケニル基、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル基、ハロ $C_2$ - $C_6$ アルキニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル

基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、

【0013】フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキ

ル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、芳香環上の隣接した2個の $Y^1$ は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

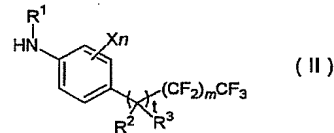
【0014】 $Y^2$ は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル

スルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

【0015】 $Y^3$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。 $p$ は0~2の整数を示し、 $q$ は0~4の整数を示し、 $r$ は0~3の整数を示す。)を示す。)で表される置換アニリド誘導体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法に関するものであり、更には置換アニリド誘導体を製造するための中間体化合物である一般式(II)

【0016】

【化10】



(式中、 $R^1$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノ基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

【0017】 $R^2$ は水素原子、ハロゲン原子又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基を示す。 $R^3$ は水素原子、ハロゲン原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、

50

【0020】Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオカルボニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、nは1~4の整数を示す。又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。)で表される置換アニリン誘導体に



関するものである。

#### 【0021】

【発明の実施の形態】本発明の置換アニリド誘導体の一般式(I)の定義において「ハロゲン原子」とは、塩素原子、臭素原子、フッ素原子又はヨウ素原子を示し、「n-」とはノルマルを、「s-」とはセカンダリーを、「t-」とはターシャリーを、「i-」とはイソを示し、「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、「ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、「C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル」とは、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の環状の炭素原子数3~6個のアルキル基を示す。

【0022】「複素環基」とは、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子から選択される1以上のヘテロ原子を有する5又は6員複素環基を示し、例えばピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等を例示することができ、「縮合環」としては、例えばナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベンゾジオキサソール、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベ

ンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等を例示することができる。

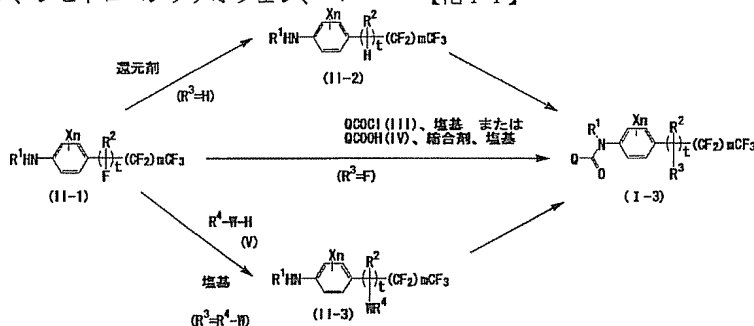
【0023】本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体は、その構造式中に炭素-炭素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

【0024】本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、Qとして好ましいものは、Q9、Q14又はQ15であり、特に好ましくはQ9であり、Y<sup>1</sup>として好ましくはハロゲン原子又はC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキル基であり、特に好ましくは3、5-ジメチル基であり、Y<sup>3</sup>として好ましくはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル基又はフェニル基であり、特に好ましくはメチル基であり、X<sub>n</sub>として好ましくは2位C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>アルキル基であり、特に好ましくは2位C<sub>6</sub>アルキル基であり、Zとして特に好ましくは酸素原子であり、R<sup>1</sup>として特に好ましくは水素原子であり、R<sup>2</sup>として特に好ましくはトリフルオロメチル基であり、R<sup>3</sup>として好ましくは水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルコキシ基であり、特に好ましくは水素原子であり、mとして特に好ましくは0であり、tとして特に好ましくは1である。

【0025】以下に本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体の代表的な製造方法を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

#### 製造方法1.

#### 【化11】



(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、X、m、n、t及びQは前記に同じくし、R<sup>4</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基、置換フェニル基又はフェニルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、Wは-O-、-S-又は-N(R<sup>4</sup>)- (式中、R<sup>4</sup>は前記に同じ。))を示す。)

【0026】一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、ZがOで表される置換アニリド誘導体(I-

3)は、一般式(II-1)~一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(III)で表されるヘテロ環カルボン酸クロリドを塩基の存在下又は不存在下に、不活性溶媒中で反応させることにより、又は一般式(II-1)~一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(IV)で表されるヘテロ環カルボン酸を縮合剤の存在下に、塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で反応させるこ

とにより製造することができるが、通常のアミド類の製造方法であれば良い。一般式(II-2)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を還元剤の存在下、不活性溶媒中で還元することにより製造することができる。一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で一般式(V)で表されるアルコール誘導体、チオール誘導体又はアミン誘導体と反応させることにより製造することができる。

【0027】一般式(II-1)→一般式(II-2). 本反応で使用する還元剤としては、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素ナトリウム、ジイソブチルアルミニウムヒドريد、水素化ビス(2-メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム等の金属水素化物、金属リチウム等の金属又は金属塩等を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

【0028】一般式(II-1)→一般式(II-3). 本反応で使用する塩基としては水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等の金属アルコール類、n-ブチルリチウム、s-ブチルリチウム、t-ブチルリチウム等のアルキル金属類を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖

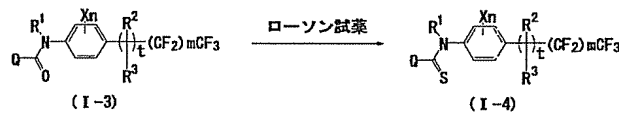
状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。反応温度は-70℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

【0029】一般式(II-1)、一般式(II-2)又は一般式(II-3)→一般式(I-3). 本反応で使用する縮合剤としては、例えばシアノリン酸ジエチル(DEPC)、カルボニルジイミダゾール(CDI)、1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2-クロロ-1-メチルピリジニウム等を例示することができる。本反応で使用する塩基としては、無機塩基又は有機塩基が挙げられ、無機塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属原子の水酸化物や水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属の水素化物、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等のアルコールのアルカリ金属塩、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の炭酸塩類、有機塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン、DBU等を例示することができ、その使用量は一般式(IV)で表されるヘテロ環カルボン酸誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から選択して使用すれば良い。

【0030】本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及びアセトン、メチルエチルケトン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもでき、反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。本反応の原料化合物である一般式(II-1)で表されるア

ニリン誘導体は、特開平11-302233号公報又は  
特開2001-122836号公報に開示の製造方法で  
製造することができる。

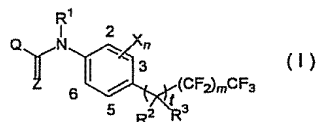
【0031】製造方法2。  
【化12】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $n$ 、 $t$ 及び $Q$ は前記に同じ。)

一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、 $Z$ が $S$ で表される置換アニリド誘導体(I-4)は、(I-3)で表されるアニリン誘導体を公知の方法(Tetrahedron Lett., 21(42), 4061(1980))に準じてローソン試薬と反応させることにより製造することができる。

【0032】一般式(I)で表される置換アニリド誘導体一般式(I)



第1表 ( $Q=Q9$ 、 $R^1=H$ 、 $R^2=CF_3$ 、 $Z=O$ 、 $t=1$ )

No.	$X_n$	$Y^1_p$	$Y^3$	$m$	$R^3$	物性
1-1	2-Me	3- $CF_3$	Me	0	F	146-148
1-2	2-Et-6- <i>s</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	119
1-3	2- <i>n</i> -Pr	3- $CF_3$	Me	0	F	152-153
1-4	2- <i>n</i> -Pr	3-Me-5-Cl	Me	0	H	85-87
1-5	2- <i>i</i> -Pr	3- $CF_3$	Me	0	F	170-172
1-6	2- <i>i</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-7	2- <i>i</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-8	2- <i>s</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	106
1-9	2- <i>s</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-10	2- <i>t</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	124-125
1-11	2- <i>t</i> -Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-12	2-( $CH_2$ ) <sub>4</sub> -3	3- $CF_3$	Me	0	F	125-128
1-13	2-( $CH_2$ ) <sub>4</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-14	2-( $CH_2$ ) <sub>4</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	165-166
1-15	2-( $CH_2$ ) <sub>4</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-16	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	

【0034】

【表2】

第1表 (続き)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>a</sup>	m	R <sup>3</sup>	物性
1-17	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	130-131
1-18	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-19	2-Ph	3-CF <sub>3</sub>	Me	0	F	139-140
1-20	2-Ph	3-Me-5-Cl	Me	0	H	145-147
1-21	2-CH(Me)CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	F	121
1-22	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	H	82-83
1-23	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	1.4983(19.1)
1-24	2-CH(Me)CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-25	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	1.5051(20.1)
1-26	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	1.4921(20.2)
1-27	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	H	Me	0	H	
1-28	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	Me	0	F	138-139
1-29	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	Et	0	H	
1-30	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	Me	0	H	146-147
1-31	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	Me	0	OMe	
1-32	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	Me	0	OE <sub>t</sub>	
1-33	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	0	H	1.4650(19.9)
1-34	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me	Me	0	H	1.4970(19.9)
1-35	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Et	Me	0	H	35-38
1-36	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3- <i>i</i> -Pr	Me	0	H	45-47
1-37	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-F	Me	0	H	

【0035】

【表3】

第1表(続き)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>2</sup>	m	R <sup>3</sup>	物性
1-38	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Cl	Me	0	H	
1-39	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br	Me	0	H	1.5111(22.2)
1-40	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I	Me	0	H	アモルファス
1-41	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-SMe	Me	0	H	129-130
1-42	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-SOMe	Me	0	H	
1-43	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-SO <sub>2</sub> Me	Me	0	H	
1-44	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-OMe	Me	0	H	102-105
1-45	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Me	Me	0	H	1.4790(25.2)
1-46	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-SMe	Me	0	H	1.6201(16.8)
1-47	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-SOMe	Me	0	H	1.4930(23.7)
1-48	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-SO <sub>2</sub> Me	Me	0	H	48
1-49	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-F	Me	0	H	
1-50	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Cl	Me	0	H	
1-51	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Cl	Et	0	H	1.5110(21.7)
1-52	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Cl	CH <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> F	0	H	1.4931(22.5)
1-53	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Br	Me	0	H	
1-54	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Br	Et	0	H	1.5061
1-55	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Br	<i>t</i> -Bu	0	H	67-68
1-56	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-I	Me	0	H	119-120
1-57	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-I	Et	0	H	132-133
1-58	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-I	<i>t</i> -Bu	0	H	98-99
1-59	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-I	Ph	0	H	127-128
1-60	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Cl-5-Me	Me	0	H	95-97

【0036】

【表4】

第1表 (続き)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>3</sup>	m	R <sup>3</sup>	物性
1-61	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br-5-Me	Me	0	H	1.5208(21.1)
1-62	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I-5-Me	Me	0	H	1.5252(21.1)
1-63	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I-5-Me	Et	0	H	170-171
1-64	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-F	Me	0	F	
1-65	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-F	Me	0	H	1.4974(22.8)
1-66	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-F	Me	0	OMe	
1-67	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-F	Me	1	F	
1-68	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-F	Me	1	H	
1-69	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-F	Me	1	OMe	
1-70	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	F	88-90
1-71	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.5025(23.7)
1-72	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	アモルファス
1-73	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	OE <sub>t</sub>	1.5003(15.7)
1-74	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	1	F	
1-75	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	1	H	
1-76	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe	
1-77	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	1	OE <sub>t</sub>	
1-78	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Et	0	H	1.4905(21.2)
1-79	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Et	0	OMe	
1-80	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Et	0	OE <sub>t</sub>	
1-81	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Br	Me	0	H	134-135
1-82	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Br	Me	0	OMe	96-97
1-83	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Br	Et	0	OH	1.5140(22.2)

【0037】

【表5】

第1表 (続き)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>3</sup>	m	R <sup>3</sup>	物性
1-84	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Br	Et	0	H	153-155
1-85	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Et-5-Br	Me	0	H	110-112
1-86	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Et-5-Br	Me	0	OMe	アモルファス
1-87	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-I	Me	0	H	184-185
1-88	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-I	Me	0	OMe	
1-89	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-I	Et	0	H	174
1-90	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-SMe	Me	0	H	1.5140(22.2)
1-91	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-SMe	Me	0	OMe	
1-92	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-SOMe	Me	0	H	42-43
1-93	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-SOMe	Me	0	OMe	
1-94	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-SO <sub>2</sub> Me	Me	0	H	1.4993(22.1)
1-95	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-SO <sub>2</sub> Me	Me	0	OMe	
1-96	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-OMe	Me	0	H	1.5020(20.9)
1-97	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-OMe	Me	0	OMe	
1-98	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-OPh	Me	0	H	1.5182(20.5)
1-99	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-OPh	Me	0	OMe	
1-100	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-OMe-5-Br	Me	0	H	143-144
1-101	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-OMe-5-SP <sub>r-n</sub>	Me	0	H	102
1-102	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -5-Cl	Et	0	H	
1-103	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -5-Cl	Me	0	H	102-104

第1表 (続き)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>2</sup>	m	R <sup>3</sup>	物性
1-104	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -5-Cl	Me	0	OMe	1.4712(18.2)
1-105	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -5- OPh	Me	0	H	1.4951(19.4)
1-106	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	81-82
1-107	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	1.4958(15.7)
1-108	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	94-96
1-109	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OEt	1.4958(20.1)
1-110	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	F	
1-111	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	H	
1-112	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	OMe	
1-113	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	OEt	
1-114	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	F	1.4950(18.4)
1-115	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	H	
1-116	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	OMe	
1-117	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	OEt	
1-118	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	<i>n</i> -Pr	0	F	1.4907(19.2)
1-119	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	<i>n</i> -Pr	0	H	1.4970(17.4)
1-120	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	<i>n</i> -Pr	0	OMe	
1-121	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	<i>n</i> -Pr	0	OEt	
1-122	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	F	
1-123	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	H	
1-124	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	OMe	
1-125	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	OEt	
1-126	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-F <sub>2</sub>	Me	0	F	

【0039】

【表7】



第1表 (続き)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>3</sup>	m	R <sup>3</sup>	物性
1-127	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-F <sub>2</sub>	Me	0	H	73
1-128	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-F <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-129	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-130	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-131	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	Et	0	H	129-130
1-132	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Et-5-Cl	Me	0	H	アモルファス
1-133	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3- <i>n</i> -Pr-5-Cl	Me	0	H	1.4890(21.5)
1-134	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3- <i>i</i> -Pr-5-Cl	Me	0	H	1.4822(20.3)
1-135	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3- <i>t</i> -Bu-5-Cl	Me	0	H	1.4881(20.3)
1-136	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-137	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-138	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-139	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	1	F	
1-140	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	1	H	1.4931(19.5)
1-141	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub> -3	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe	
1-142	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Me	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-143	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Me	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-144	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Me	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	1.5003(19.6)
1-145	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	F	1.4907(20.3)
1-146	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.4905(20.4)
1-147	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	

30

【0040】

【表8】

第 1 表 (続き)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>a</sup>	m	R <sup>g</sup>	物性
1-148	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	アモルファス
1-149	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-150	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-151	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-152	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-153	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-154	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-155	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-156	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-157	2-CH(Me)Ph	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-158	2-CH(Me)Ph	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-159	2-CH(Me)Ph	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-160	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-161	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-162	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-163	2,3-Me <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	132-136
1-164	2,3-Me <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	167-170

【0041】

30 【表 9】

第2表 (Q=Q9、R<sup>1</sup>=H、Z=O、t=1)

No.	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>3</sup>	m	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性
2-1	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	F	
2-2	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	H	
2-3	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	2	F	F	
2-4	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	2	H	H	
2-5	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	4	F	F	
2-6	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	4	H	H	
2-7	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	6	F	F	
2-8	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	6	H	H	
2-9	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	F	F	
2-10	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	0	H	H	
2-11	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	2	F	F	
2-12	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	2	H	H	
2-13	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	4	F	F	
2-14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	4	H	H	
2-15	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	6	F	F	
2-16	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me-5-Cl	Me	6	H	H	

【0042】

【表10】

第3表 ( $R^1=H$ 、 $R^2=CF_3$ 、 $Z=O$ 、 $m=0$ 、 $t=1$ )

No	Q	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p,q,r</sub> 又はY <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性
3-1	Q 1	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	H	
3-2	Q 1	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	H	108-109
3-3	Q 2	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	H	1.4860 (22.7)
3-4	Q 2	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Cl	H	68
3-5	Q 2	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Cl-6-Me	H	アモルファ ス
3-6	Q 3	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub>	H	
3-7	Q 3	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub>	H	1.5182 (20.5)
3-8	Q 6	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-SMe-4-CF <sub>3</sub>	H	
3-9	Q 6	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	H	
3-10	Q 1 1	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	Me	F	104
3-11	Q 1 1	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	Me	H	アモルファ ス
3-12	Q 1 1	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	H	85-88
3-13	Q 1 2	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	H	72-73
3-14	Q 1 2	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	OMe	
3-15	Q 1 3	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br	F	

【0043】

【表11】

第3表 (続き)

No	Q	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p, q, r</sub> 又は Y <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性
3-16	Q 1 3	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br	H	1.5080 (20.4)
3-17	Q 1 3	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br	OMe	
3-18	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Br	H	
3-19	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Br	OMe	
3-20	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Br	OEt	
3-21	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-Br	H	
3-22	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-Br	OMe	
3-23	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-Br	OEt	
3-24	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	H	
3-25	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	OMe	
3-26	Q 1 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	OEt	
3-27	Q 1 5	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	H	H	133.5-135
3-28	Q 1 5	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Cl	H	
3-29	Q 1 5	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br	H	
3-30	Q 1 5	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I	H	1.5365 (18.4)

【0044】

【表12】

第3表 (続き)

No	Q	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p, q, r</sub> 又は Y <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性
3-31	Q 1 5	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I	OMe	1.5081 (18.5)
3-32	Q 1 8	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Cl	H	104.5-106
3-33	Q 1 8	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Me-5-(2-Cl-Ph)	H	
3-34	Q 2 1	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	H	アモルフ アス
3-35	Q 2 1	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	OMe	1.4870 (19.4)
3-36	Q 2 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	H	
3-37	Q 2 4	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	OMe	

【0045】

【表13】

第4表 (R<sup>1</sup>=H、R<sup>2</sup>=CF<sub>3</sub>、Z=O、m=0、t=1)

No	Q	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub> 又は <sub>r</sub>	Y <sup>3</sup>	R <sup>3</sup>	物性
4-1	Q 8	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	4-Cl-5-Me	Me	H	160
4-2	Q 8	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	4-Br-5-Me	Me	H	149-150
4-3	Q 10	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me	Me	H	1.4848(23.6)

【0046】

【表14】

第4表 (続き)

No	Q	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub> 又は <sub>r</sub>	Y <sup>3</sup>	R <sup>3</sup>	物性
4-4	Q 10	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me-4-Cl	Me	H	108-109
4-5	Q 10	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me-4-Br	Me	H	112-113
4-6	Q 10	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3- <i>t</i> -Bu-4-Cl	Me	H	1.4915(23.9)
4-7	Q 10	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me-4-NO <sub>2</sub>	Me	H	1.4971(25.3)
4-8	Q 16	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Me	F	
4-9	Q 16	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Me	H	1.5062(18.4)
4-10	Q 16	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Me	OMe	
4-11	Q 16	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Me	OE <sub>t</sub>	
4-12	Q 16	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Et	F	
4-13	Q 16	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Et	H	
4-14	Q 16	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Et	OMe	

【0047】

【表15】

第4表(続き)

No	Q	X <sub>n</sub>	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub> 又は <sub>r</sub>	Y <sup>3</sup>	R <sup>3</sup>	物性
4-15	Q 1 6	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	Et	OE <sub>t</sub>	
4-16	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me	Me	F	
4-17	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me	Me	H	
4-18	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me	Me	OMe	
4-19	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Me	Me	OE <sub>t</sub>	
4-20	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Cl	Et	F	
4-21	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Cl	Et	H	
4-22	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Cl	Et	OMe	
4-23	Q 1 7	2- CH(Me)CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	3-Cl	Et	OE <sub>t</sub>	

【0048】第1から表4中、物性がアモルファスで示される化合物の<sup>1</sup>H-NMRデータを第5表に示す。

【表16】

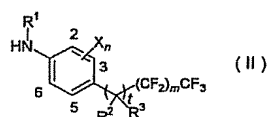
第5表

No.	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
1-40	8.20 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.32-7.25 (m, 2H), 4.05 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.20 (m, 1H), 1.65-1.40 (m, 3H), 1.24 (d, 3H), 0.84 (m, 6H)
1-72	8.04 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.46-7.39 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.03 (m, 3H), 2.52 (s, 3H), 1.69-1.40 (m, 3H), 1.23 (d, 3H), 0.84 (d, 6H)
1-86	8.01 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.47-7.39 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 3.07 (m, 1H), 2.94 (m, 1H), 1.67-1.40 (m, 3H), 1.30-1.20 (m, 6H), 0.84 (d, 6H)
1-132	7.98 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.30-7.21 (m, 2H), 4.04 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.10-2.80 (m, 3H), 1.63-1.40 (m, 3H), 1.33-1.18 (m, 6H), 0.84 (d, 6H)
1-148	8.13 (d, 1H), 7.50-7.40 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 3.77 (s, 3H), 2.82 (m, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 1.72-1.52 (m, 2H), 1.52-1.39 (m, 1H), 1.27 (d, 3H), 1.21-1.10 (m, 1H), 1.10-0.91 (m, 1H), 0.82 (d, 6H)
3-5	8.32 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.35-7.20 (m, 3H), 4.06 (m, 1H), 3.05 (m, 1H), 2.61 (s, 3H), 1.60-1.40 (m, 3H), 1.22 (d, 3H), 0.84 (d, 6H)
3-34	7.85 (d, 1H), 7.31-7.20 (m, 3H), 4.06 (m, 1H), 2.92 (m, 1H), 2.67 (s, 3H), 2.51 (s, 3H), 1.60-1.40 (m, 3H), 1.22 (t, 3H), 0.85 (m, 6H)

【0049】

【表17】

一般式 (II)



第6表 (R¹=H, t=1)

No	X n	m	R²	R³	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
5-1	2-n-Pr	0	CF <sub>3</sub>	H	7.12-7.02 (m, 2H), 6.69 (d, 1H), 4.0-3.7 (m, 3H), 2.52 (q, 2H), 1.27 (t, 3H)
5-2	2-t-Bu	0	CF <sub>3</sub>	H	7.17 (s, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.64 (d, 1H), 4.1-3.9 (br, 2H), 3.91 (m, 1H), 1.41 (s, 9H)
5-3	2-Ph	0	CF <sub>3</sub>	H	7.52-7.32 (m, 5H), 7.19-7.10 (m, 2H), 6.77 (d, 1H), 4.08-3.85 (m, 3H)
5-4	2-CH(Me)CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7.08-7.01 (m, 2H), 6.71 (s, 1H), 3.91 (m, 1H), 2.50 (m, 1H), 1.87 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.92 (d, 3H), 0.87 (d, 3H)
5-5	2-CH(Me)CHMe <sub>2</sub> -6-Et	0	CF <sub>3</sub>	H	6.96 (d, 2H), 3.92 (m, 1H), 3.85-3.70 (br, 2H), 2.65 (m, 1H), 2.53 (dd, 2H), 1.80-1.50 (m, 2H), 1.23 (d, 3H), 0.90 (t, 3H)
5-6	2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -3	0	CF <sub>3</sub>	H	7.24 (d, 1H), 6.60 (d, 1H), 4.41 (m, 1H), 3.76 (br, 2H), 2.70 (br, 2H), 2.47 (br, 2H), 1.84 (m, 4H)



【0050】

【表18】

第6表 (続き)

No	X n	m	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
5-7	2-CH=CH- CH=CH-3	0	CF <sub>3</sub>	H	7.91-7.84 (m, 2H), 7.68-7.47 (m, 3H), 6.82 (d, 1H), 4.96 (m, 1H), 4.40-4.20 (br, 2H)
5-8	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7.06-6.98 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.85-3.70 (br, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.78-1.50 (m, 2H), 1.22 (d, 3H), 0.89 (t, 3H)
5-9	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7.08-7.00 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.82-3.70 (br, 2H), 2.71 (m, 1H), 1.70-1.50 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 5H), 0.90 (t, 3H)
5-10	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OMe	7.24 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.00-3.82 (br, 2H), 3.43 (s, 3H), 2.73 (m, 1H), 1.70-1.45 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 5H), 0.90 (t, 3H)
5-11	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7.10-7.00 (m, 2H), 6.69 (s, 1H), 3.91 (m, 1H), 2.80 (m, 1H), 1.65-1.50 (m, 2H), 1.43-1.32 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.89 (t, 6H)
5-12	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OH	7.39 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.68 (d, 1H), 3.90-3.60 (br, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.61-1.50 (m, 1H), 1.45-1.35 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.89 (q, 6H)
5-13	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OMe	7.26 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.00-3.65 (br, 2H), 3.43 (s, 1H), 2.79 (m, 1H), 1.56 (m, 2H), 1.37 (m, 1H), 1.20 (d, 3H), 0.91 (t, 6H)
5-14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OEt	7.26 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 3.98-3.67 (br, 2H), 3.59 (q, 2H), 2.80 (m, 1H), 1.56 (m, 2H), 1.38 (m, 1H), 1.30 (t, 3H), 1.20 (d, 3H), 0.89 (t, 6H)

【0051】

30 【表19】

第6表 (続き)

No	X n	m	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-NMR[CDCl <sub>3</sub> /TMS, δ 値(ppm)]
5-15	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH Me <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7.08-7.00(m, 2H), 6.68(d, 1H), 3.92(m, 1H), 3.99-3.70(br, 2H), 2.65(m, 1H), 1.78-1.42 (m, 4H), 1.30-1.10(m, 5H), 0.86(d, 6H)
5-16	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7.26(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.71(d, 1H), 3.95-3.78(br, 2H), 2.69(m, 1H), 1.72-1.42 (m, 2H), 1.40-1.18(m, 7H), 0.88(t, 3H)
5-17	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	H	H	6.98(s, 1H), 6.92(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.85-3.60(br, 2H), 3.24(dd, 2H), 2.79(m, 1H), 1.65-1.48(m, 2H), 1.45-1.30(m, 1H), 1.19(d, 3H), 0.90(t, 6H)
5-18	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2	H	H	6.97(s, 1H), 6.90(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.82-3.40(br, 2H), 3.23(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.70-1.50(m, 2H), 1.39(m, 1H), 1.20(d, 3H), 0.90(t, 6H)
5-19	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4	H	H	6.97(s, 1H), 6.92(d, 1H), 6.65(d, 1H), 4.00-3.70(br, 2H), 3.24(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.68-1.48(m, 2H), 1.45-1.30 (m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.89(m, 6H)
5-20	2-CH(Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	6	H	H	6.97(s, 1H), 6.90(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.24(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.67-1.45(m, 2H), 1.42-1.30(m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.90(t, 6H)

## 【0052】

【実施例】以下に本発明の代表的な実施例、製剤例及び試験例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1-1. 2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (化合物No. 5-11) の製造

水素化リチウムアルミニウム (2 g, 52.7 mmol) をテトラヒドロフラン (60 ml) に懸濁させ、2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (14 g, 40.5 mmol) を滴下し、還流温度で3時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を少量ずつ加え、その後10分間攪拌した。硫酸マグネシウムを加え、その後10分間攪拌した。反応液をセライトろ過し、ろ液を減圧濃縮することにより、目的物13 gを得た。

収率98%

実施例1-2. N- {2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} -5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-カルボン酸アミド (化合物No. 1-103) の製造。

5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-カルボン酸 (230 mg, 1 mmol) をチオニルクロリド (2 ml) に溶解し、還流温度で2時間攪拌した。減圧濃縮後、得られた酸クロリドを2-

(1, 3-ジメチルブチル) -4- [2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (330 mg, 1 mmol) 及びトリエチルアミン (150 mg, 1.5 mmol) をテトラヒドロフラン (10 ml) に溶解した溶液に氷冷下に加え、室温で2時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=3:1) にて分離精製することにより目的物233 mgを得た。

物性：融点102-104℃ 収率43%

【0053】実施例2-1. 2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (化合物No. 5-13) の製造

ナトリウム (533 mg, 23 mmol) をメタノール (40 ml) に溶解した後、2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] アニリン (2 g, 5.8 mmol) を加え、還流温度で3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、残渣を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=6:1) にて分離精製することにより目的物1.8 gを得た。

収率87%

実施例2-2. N- {2- (1, 3-ジメチルブチル) -4- [1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ

ー1ー(トリフルオロメチル)エチル]フェニル)ー1, 3, 5-トリメチルピラゾールー4-カルボン酸アミド(化合物No. 1-108)の製造。

1, 3, 5-トリメチルピラゾールー4-カルボン酸(154mg, 1mmol)をチオニルクロリド(5ml)に溶解し、2時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮後、得られた酸クロリドを氷冷下、2-(1, 3-ジメチルブチル)ー4-[1-メトキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(345mg, 1mmol)及びトリエチルアミン(150mg, 1.5mmol)をテトラヒドロフラン(10ml)に溶解した溶液に加え、その後2時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:2)にて分離精製することにより目的物200mgを得た。

物性: 融点94-96℃ 収率41%

【0054】実施例3-1. 2-(1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペンチル)アニリンの製造  
ジエチルエーテル(15ml)にマグネシウム(960mg, 40mmol)を加え、触媒量のヨウ素を加えた後、イソアミルブロミド(6.04g, 40mmol)を還流下徐々に加え、還流温度で30分間攪拌後、室温で30分間攪拌した。この溶液に、氷冷下に2-アミノアセトフェノン(1.8g, 13.3mmol)を加え、室温で3時間攪拌した。塩化アンモニウムを加えた後、酢酸エチルで希釈し、水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、2-(1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペンチル)アニリン2.7gを得た。

物性: <sup>1</sup>H-NMR[CDC1<sub>3</sub>/TMS, δ値(ppm)]

7.10-7.00(m, 2H), 6.72-6.60(m, 2H), 4.00-3.70(br, 2H), 2.03(m, 2H), 1.61(s, 3H), 1.50(m, 2H), 1.20-1.00(m, 1H), 0.90-0.83(m, 6H)

収率99%

実施例3-2. 2-(1, 4-ジメチルペンチル)アニリンの製造

実施例3-1で得られた2-(1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペンチル)アニリン2.7g(13.1mmol)をトルエンに希釈し、パラトルエンスルホン酸一水和物(225mg)を加え、ディーンスターク管で還流下3時間かけて脱水した。反応液を酢酸エチルで希釈後、重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣を、エタノールに溶解し、5%パラジウムカーボン(100mg)を加え、水素雰囲気下室温で12時間攪拌した。反応液をセライトろ過し、残渣を減圧濃縮し、2-(1, 4-ジメチルペンチル)アニリン2.2gを得た。

物性: <sup>1</sup>H-NMR[CDC1<sub>3</sub>/TMS, δ値(ppm)]

7.10(dd, 2H), 7.02(dt, 1H), 6.79(dt, 1H), 6.69(dd, 1H), 3.67(bs, 2H), 2.68(m, 1H), 1.80-1.42(m, 4H), 1.30-1.10(m, 5H), 0.87(d, 6H)

収率87%

【0055】実施例3-3. 2-(1, 4-ジメチルペンチル)ー4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンの製造  
実施例3-2で得られた2-(1, 4-ジメチルペンチル)アニリン(1.8g, 9.4mmol)をt-ブチルメチルエーテル-水の1:1の溶液(50ml)に溶解し、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルヨージド(2.78g, 9.4mmol)、テトラ-n-ブチルアンモニウム硫酸水素塩(318mg, 0.94mmol)、炭酸水素ナトリウム(795mg, 9.4mmol)、亜ジチオン酸ナトリウム(1.63g, 9.4mmol)を順次加え、室温で12時間攪拌した。反応液をヘキサンで希釈し、3N-塩酸で2度洗浄後、重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、目的物3.28gを得た。

物性: <sup>1</sup>H-NMR[CDC1<sub>3</sub>/TMS, δ値(ppm)]

7.26(s, 1H), 7.21(d, 1H), 6.72(d, 1H), 4.05-3.80(br, 2H), 2.67(m, 1H), 1.78-1.40(m, 4H), 1.30-1.00(m, 5H), 0.85(d, 6H)

収率97%

実施例3-4. 2-(1, 4-ジメチルペンチル)ー4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(化合物No. 5-15)の製造

2-(1, 3-ジメチルブチル)ー4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンのかわりに2-(1, 4-ジメチルペンチル)ー4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンを用いた以外は実施例1-1と同様にして、4時間反応を行うことにより目的物を得た。

収率82%

【0056】実施例3-5. N-{2-(1, 4-ジメチルペンチル)ー4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}ー5-クロロ-1, 3-ジメチルピラゾールー4-カルボン酸アミド(化合物No. 1-146)の製造  
5-クロロ-1, 3-ジメチルピラゾールー4-カルボン酸(349mg, 2mmol)をチオニルクロリド(10ml)に溶解し、還流温度で2時間攪拌した。減圧濃縮後、得られた酸クロリドを2-(1, 4-ジメチルペンチル)ー4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(682mg, 2mmol)及びトリエチルアミン(300mg, 3mmol)をテトラヒドロフラン(20ml)に溶解

した溶液に氷冷下に加え、還流温度で2時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝2：3）にて分離精製することにより目的物200mgを得た。

物性：屈折率1.4905（20、4℃） 収率41%

【0057】実施例4-1. 4-ヨード-2-（1,3-ジメチルブチル）アニリンの製造

ヨウ素2.53g（10mmol）をメタノールに溶解し、2-（1,3-ジメチルブチル）アニリンを（1.77g, 10mmol）を氷冷下加えたのち、炭酸水素ナトリウム（1.26g, 15mmol）の水溶液を加え0℃で4時間攪拌した。反応液にチオ硫酸ナトリウムを加えた後、減圧濃縮し、酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝10：1）にて分離精製し、目的物2.71gを得た。

収率89%

実施例4-2. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-ペンタフルオロエチル-アニリンの製造

4-ヨード-2-（1,3-ジメチルブチル）アニリン（1.35g, 4.45mmol）、銅粉（0.85g, 13.4mmol）、ペンタフルオロエチルヨージド（1.42g, 5.77mmol）をジメチルスルホキシド（10ml）に加え、130℃で4時間攪拌した。セライトろ過後、ろ液を酢酸エチルで希釈し、4回水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し目的物1.24gを得た。

物性：<sup>1</sup>H-NMR[CDCl<sub>3</sub>/TMS, δ値(ppm)]

7.26(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.70(d, 1H), 4.00-3.85(br, 2H), 3.00(m, 1H), 1.68-1.50(m, 2H), 1.48-1.30(m, 1H), 1.22(t, 3H), 0.94(m, 6H) 収率95%

【0058】実施例4-3. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-（2,2,2-トリフルオロエチル）アニリン（化合物No. 5-17）の製造

水素化リチウムアルミニウム（1.62g, 4.26mmol）をテトラヒドロフラン（20ml）に溶解し、2-（1,3-ジメチルブチル）-4-ペンタフルオロエチルアニリン（974mg, 3.3mmol）を滴下し、還流温度で3時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を少量ずつ加え、その後10分間攪拌した。硫酸マグネシウムを加え、その後10分間攪拌した。反応液をセライトろ過し、ろ液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝9：1）にて分離精製し目的物260mgを得た。

収率30%

【0059】実施例5-1. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-ノナフルオロブチルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにノナフルオロブチルヨージドを用いた以外は実施例4-2と同様にして4時間反応を行うことにより目的物を得た。

物性：<sup>1</sup>H-NMR[CDCl<sub>3</sub>/TMS, δ値(ppm)]

7.25(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.71(d, 1H), 4.02-3.85(m, 2H), 2.79(m, 1H), 1.68-1.50(m, 2H), 1.50-1.35(m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.90(t, 6H)

収率90%

実施例5-2. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-（2,2,3,3,4,4,4-ヘptaフルオロヘキシル）アニリン（化合物No. 5-18）の製造

2-（1,3-ジメチルブチル）-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに2-（1,3-ジメチルブチル）-4-ノナフルオロブチルアニリンを用いた以外は実施例4-3と同様にして3時間攪拌することにより目的物を得た。

収率92%

【0060】実施例6-1. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-トリデカフルオロヘキシルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにトリデカフルオロヘキシルヨージドを用いた以外は実施例4-2と同様にして4時間反応を行うことにより目的物を得た。

物性：<sup>1</sup>H-NMR[CDCl<sub>3</sub>/TMS, δ値(ppm)]

7.25(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.71(d, 1H), 4.05-3.87(m, 2H), 2.79(m, 1H), 1.68-1.50(m, 2H), 1.48-1.30(m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.90(t, 6H)

収率87%

実施例6-2. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-（2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,6-ウンデカフルオロヘキシル）アニリン（化合物No. 5-19）の製造

2-（1,3-ジメチルブチル）-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに2-（1,3-ジメチルブチル）-4-トリデカフルオロヘキシルアニリンを用いた以外は実施例4-3と同様にして3時間攪拌することにより目的物を得た。

収率85%

【0061】実施例7-1. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-ヘプタデカフルオロオクチルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにヘプタデカフルオロオクチルヨージドを用いた以外は実施例4-2と同様にして4時間反応を行うことにより目的物を得た。

物性：<sup>1</sup>H-NMR[CDCl<sub>3</sub>/TMS, δ値(ppm)]

7.24(s, 1H), 7.19(d, 1H), 6.70(d, 1H), 4.05-3.85(br, 2H), 2.78(m, 1H), 1.67-1.50(m, 3H), 1.50-1.32(m, 1H), 1.21(d, 3H), 0.89(t, 6H)

収率40%

実施例7-2. 2-（1,3-ジメチルブチル）-4-

(2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ペンタデカフルオロオクチル) アニリン (化合物No. 5-20) の製造

2- (1, 3-ジメチルブチル) -4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに2- (1, 3-ジメチルブチル) -4-ヘプタデカフルオロオクチルアニリンを用いた以外は実施例4-3と同様にして3時間攪拌することにより目的物を得た。

収率58%

【0062】本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体を有効成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤、又は殺ダニ剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉用を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana* f. *asciata*)、チャノコカクモンハマキ(*Adoxophyes* sp.)、リンゴコシンクイ(*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ(*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ(*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ(*Olethreutes mori*)、チャノホソガ(*Caloptilia theviora*)、リンゴホソガ(*Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ(*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ(*Spulerina asturoides*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae crucivora*)、オオタバコガ類(*Heliothis* sp.)、コドリリング(*Laspeyresia pomonella*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、モモシンクイガ(*Carposina niponensis*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、

【0063】クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ(*Spodoptera egigua*)等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ(*Macrostelus fascifrons*)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、ミカンキジラミ(*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ(*Aleurolobus taenabae*)、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ(*Trialetodes vaporariorum*)、ニセダイコンアブラムシ(*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、ツノロウムシ(*Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカイガラムシ(*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ(*Pseudonidia duplex*)、ナシマルカイガラムシ(*Comstockaspis perniciosus*)、ヤノネカイガラムシ(*Unaspis yanonensis*)等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ(*Pratylenchus* sp.)、ヒメコガネ(*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ(*Popillia japonica*)、タバコシバンムシ(*Lasioderma serricornis*)、ヒラタキク

イムシ(*Lyctus brunneus*)、

【0064】ニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintioctopunctata*)、アズキゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、コクゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis grandis*)、イネミズゾウムシ(*Lissonotus oryzae*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ(*Tomicus piniperda*)、コロラドポテトビートル(*Lepidoptera decemlineata*)、メキシカンビーンビートル(*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム類(*Diabrotica* sp.)等の甲虫目害虫、ウリミバエ(*Dacus* (*Zeugodacus*) *cucurbitae*)、ミカンコミバエ(*Dacus* (*Bactrocera*) *dorsalis*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ(*Delia antiqua*)、タネバエ(*Dalia platura*)、ダイズサヤタマバエ(*Asphondylia* sp.)、イエバエ(*Musca domestica*)、アカイエカ(*Culex pipiens pipiens*)等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ(*Glabodera rostchinskii*)、ネコブセンチュウ(*Meloidogyne* sp.)、

【0065】ミカンネセンチュウ(*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ(*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ(*Aphelenchoides ritzemabosi*)等のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ(*Panonychus citri*)、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ(*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ(*Tetranychus kanzawai* Kishida)、ナミハダニ(*Tetranychus urticae* Koch)、チャノナガサビダニ(*Acaephylla theae*)、ミカンサビハダニ(*Aculops pelekassi*)、チャノサビダニ(*Calacar carinatus*)、ナシサビダニ(*Epitrimerus pyri*)等のダニ目害虫に対して強い殺虫効果を有するものである。

【0066】又、本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体を有効成分とする農園芸用薬剤は農園芸用殺菌剤としても有用であり、例えば稲いもち病(*Pyricularia oryzae*)、稲紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、稲胡麻葉枯病(*Cochiobolus miyabeanus*)、大麦及び小麦のうどんこ病(*Erysiphe graminis*)の如き種々の宿主植物についてのうどんこ病、エンバクの冠さび病(*Puccinia coronata*)及び他の植物のさび病、トマトの疫病(*Phytophthora infestans*)及び他の植物の疫病、キュウリのべと病(*Pseudoperonospora cubensis*)、ブドウのべと病(*Plasmopara viticola*)等の種々植物のべと病、リンゴ黒星病(*Venturia inaequalis*)、リンゴ斑点落葉病(*Alternaria mali*)、ナシ黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、カンキツ黒点病(*Diaporthe citri*)、シュードモナス種、例えばキュウリ斑点細菌病(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)、トマト青枯病(*Pseudomonas solanacearum*)、

キサントモナス種、例えばキャベツ黒腐病(*Xanthomonas campestris*)、稲白葉枯病(*Xanthomonas oryzae*)、カンキツかいよう病(*Xanthomonas citri*)、エルウィニア種、例えばキャベツ軟腐病(*Erwinia carotovora*)等の細菌病、タバコモザイク病(*Tabacco mosaic virus*)等の病害に対して極めて高い防除効果を示すものである。

【0067】本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。本発明の農園芸用薬剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。即ち、一般式(I)で表される置換アニリド誘導体はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

【0068】本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキスを抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類(例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン(含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。))、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫酸、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

【0069】液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するもの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散せしめることとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類(例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル

類(例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジブロピルエーテル、テトラヒドロフラン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソブチルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

【0070】他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

【0071】固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。消泡剤としては、例えばシリコン油等の補助剤を使用することもできる。防腐剤としては、1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン、パラクロロメタキシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等も添加することが出来る。更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01~90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば粉剤又は粒剤とする場合は0.01~50重量%、又乳剤又は水和剤とする場合も同様0.01~5

0重量%が適当である。本発明の農園芸用薬剤は各種病害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害虫防除に有効な量を当該病害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

【0072】本発明の農園芸用薬剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g~10kg、好ましくは0.01g~1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。本発明の農園芸用薬剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例えばエチオン、トリクロロホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロロボス、メビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカルバム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレド、メチルパラチオン、フェントロチオン、シアノホス、プロパホス、

【0073】フェンチオン、プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、ジメチルビンホス、クロルフェビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス・メチル、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、ホスメット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カズサホス、メスルフェンホス、DPS（NK-0795）、ホスホカルブ、フェナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、レスメトリン、ペルメトリン、テフルトリン、ビフェントリン、フェンプロパトリン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、シハロトリン、ラムダ・シハロトリン、デルタメトリン、アクリナトリン、

【0074】フェンバレレート、エスフェンバレレート、フルシトリネート、フルバリネート、シクロプロトリン、エトフェンプロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフェン、フルシトリネート、フルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカルブ、プロボキスル、フェノキシカルブ、フェノブカルブ、エチオフェンカルブ、フェノチオカルブ、ビフェ

ナゼート、BPMC、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジフルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズロン、酸化フェンブタズ、水酸化トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メトブレン、ハイドロブレン、ビナパクリル、アミトラズ、ジコホル、ケルセン、クロルベンジレート、フェニソプロモレート、テトラジホン、ベンスルタップ、ベンゾメート、テブフェノジド、メトキシフェノジド、

【0075】クロマフェノジド、プロバルギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナビル、フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピラム、アセタミプリド、チアクロプリド、イミダクロプリド、チアメトキサム、クロチアニジン、ニジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドラメチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、TPIC（トリプロピルイソシアヌレート）、ピメトロジン、クロフェンテジン、ブプロフェジン、チオシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチン複合体、ミルベメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピノサッド、BT（バチルス・チューリンゲンシス）、アザディラクチン、ロテノン、ヒドロキシプロピルデンブン、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、バストリア、モナクロスポリウム・フィマトパガム等の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤を例示することができ、同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤としては、

【0076】例えば硫黄、石灰硫黄合剤、塩基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオフアネート、チオフアネートメチル、ペノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、フラメトピル、チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロパミド、ジクロフルアニド、フルスルファミド、クロロタロニル、クレソキシム・メチル、フェノキサニル（NNF-9425）、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオルイミド、プロシミドン、ピンクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、トリフルミゾール、ピテルタノール、トリフルミゾール、イブコナゾール、フルコナゾール、プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、ミクロブタニル、テトラコナゾール、ヘキサコナゾール、テブコナゾール、

【0077】イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエート、シプロコナゾール、イソプロチオラン、フェナリモル、ピリメタニル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジン、アゾキシストロビン、チアジアジン、キャプタン、プロベナゾール、アシベンゾフラール-S-メチル (CGA-245704)、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネート、オキシロニック酸、ジチアノン、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシシン、ブラストサイジン、ストレプトマイシン等の農園芸用殺菌剤を例示することができ、同様に除草剤としては、例えばグリホサート、スルホセート、グルホシネート、ビアラホス、ブタミホス、エスプロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニュロン、ダイムロン、ベンスルフロネーメチル、シクロスルファミロン、シノスルフロネ、ピラゾスルフロネエチル、アジムスルフロネ、イマゾスルフロネ、テニルクロール、アラクロール、プレチラクロール、クロメプロップ、エトベンザニド、メフェナセツト、

【0078】ペンディメタリン、ビフェノックス、アシフルオフエン、ラクトフェン、シハロホップーブチル、アイオキシニル、プロモブチド、アロキシジム、セトキシジム、ナプロパミド、インダノファン、ピラゾレート、ベンゾフェナップ、ピラフルフェン・エチル、イマザビル、スルフェントラゾン、カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサゾアゾン、パラコート、ジクワット、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメトリン、トリアジフラム、ベンフレセート、フルチアセツト・メチル、キザロホップ・エチル、ベントラゾン、過酸化カルシウム等の除草剤を例示することができる。

【0079】又、生物農薬として、例えば核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus, NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus, GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus, CPV)、昆虫ボックスウイルス (Entomopox virus, EPV) 等のウイルス製剤例1。

第1表乃至第4表記載の化合物	10部
キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

## 製剤例2。

第1表乃至第4表記載の化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

## 製剤例3。

第1表乃至第4表記載の化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部

ルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトバガム (Monocrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーボカプサエ (Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema kushidai)、パスツール・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobactor)、非病原性エルビニア・カロトボラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

【0080】更に、生物農薬として例えばオンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレマンアブラバチ (Aphidius colemani)、ショクガタマバエ (Aphidoletes aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメリスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ (Orius sauteri) 等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (Beauveria brongniartii) 等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチルー1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

【0081】以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

## 【0082】



リゲニンスルホン酸カルシウム  
以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、  
製剤例4.

第1表乃至第4表記載の化合物

カオリンと合成高分散珪酸

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

【0083】試験例1. コナガ(*Plutella xylostella*)  
に対する殺虫試験。

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼  
2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第1表乃至第4  
[数1]

5部  
乾燥して粒剤とする。

20部

75部

5部

表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を500ppm  
に希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の  
10 恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査  
し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って  
判定を行った。1区10頭3連制

無処理区孵化虫数－処理区孵化虫数

補正死虫率(%) =  $\frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$

無処理区孵化虫数

【0084】

判定基準.

A・・・死虫率100%

B・・・死虫率99%～90%

C・・・死虫率89%～80%

D・・・死虫率79%～50%

上記試験の結果、B以上の殺虫活性を示した化合物は1  
－2, 1－4, 1－10, 1－14, 1－17, 1－2  
0, 1－21, 1－26, 1－28, 1－33, 1－3  
5, 1－41, 1－48, 1－52, 1－56～58,  
1－65, 1－70, 1－73, 1－82, 1－10  
3, 1－107, 1－108, 1－132, 1－13  
3, 1－143, 1－145, 1－146, 1－16  
[数2]

3, 1－164, 3－2, 3－3, 3－4, 3－10,  
3－12, 4－1, 4－4, 及び4－5であった。

20 【0085】試験例2. チャノコカクモンハマキ (*Adox  
ophyes* sp.) に対する殺虫試験。

第1表乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤  
を500ppmに希釈した薬液にチャ葉を約30秒間浸  
漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入  
れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25  
℃、湿度70%の恒温室に静置した。接種8日後に生死  
虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、試験例  
1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

無処理区生存虫数－処理区生存虫数

補正死虫率(%) =  $\frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$

無処理区生存虫数

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1－5  
2, 1－60, 1－103, 3－12, 3－28, 3－  
30及び3－31であった。

【0086】試験例3. ナミハダニ(*Tetranychus urtic  
ae*) に対する殺ダニ試験。

インゲン葉で直径2cmのリーフディスクを作成し、湿  
潤濾紙上に置き、そこへ雌成虫を接種した後、第1表乃  
至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を500  
ppmに希釈した薬液50mlをターンテーブル上で均  
一に散布し、散布後25℃の恒温室に静置した。薬剤処  
理2日後に死亡虫数を調査し、試験例1の判定基準に従  
って判定した。1区10頭2連制

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1－2

2, 1－23, 1－25, 1－26, 1－34, 1－39,

1－40, 1－51, 1－52, 1－54, 1－60～6

2, 1－65, 1－70～73, 1－78, 1－81, 1－

82, 1－103, 1－104, 1－106～109, 1－  
119, 1－132, 1－143, 1－146, 3－13,  
3－21, 3－30～32及び4－3であった。

【0087】試験例4. モモアカアブラムシ(*Myzus per  
sicae*) に対する殺虫試験。

40 直径8cm、高さ8cmのプラスチックポットにハクサ  
イを植え、モモアカアブラムシを繁殖させた後、第1表  
乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を50  
0ppmに希釈した薬液を莖葉部に十分に散布した。風  
乾後、ポットを温室内に静置し、薬剤散布6日後に各ハ  
クサイに寄生しているモモアカアブラムシ数を調査し、  
防除価を算出し、下記基準に従って判定を行った。

[数3]

防除価(%) =  $100 - \left[ \frac{(T \times Ca)}{(Ta \times C)} \right] \times 100$

50 Ta: 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数  
 Ca : 無処理区の散布前寄生虫数  
 C : 無処理区の散布後寄生虫数

## 【0088】判定基準

A : 防除価100%  
 B : 防除価99~90%  
 C : 防除価89~80%  
 D : 防除価79~50%

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-

4, 1-8, 1-25, 1-35, 1-41, 1-52, 1-65, 1-81, 1-87, 1-106~108、1-146, 3-27, 3-13, 3-34及び4-1であった。

【0089】試験例5. オオムギうどんこ病に対する防除試験。

ポット植えのオオムギ(1葉期)にうどんこ病菌(Erysiphe graminis hordei)の孢子ふりかけて接種し、1日後に第1表、第3表又は第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を200ppmに希釈した薬液を散布し、25℃の恒温室に静置した。接種1週間後にその病斑面積を調査し、無処理区と対比して下記の基準で防除効果を判定した。

phe graminis hordei)の孢子ふりかけて接種し、1日後に第1表、第3表又は第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を200ppmに希釈した薬液を散布し、25℃の恒温室に静置した。接種1週間後にその病斑面積を調査し、無処理区と対比して下記の基準で防除効果を判定した。

判定基準 A : 防除価100~95%

B : 防除価94~80%

C : 防除価79~60%

D : 防除価59~0%

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-

5, 1-12, 1-23, 1-30, 1-45, 1-47, 1-52, 1-54, 1-83, 1-133, 3-30, 3-31及び4-3であった。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.<sup>7</sup>

識別記号

F I

テマコード(参考)

A O 1 N 43/36

A O 1 N 43/36

A 4 C 0 5 6

43/40

1 0 1

43/40

1 0 1

4 C 0 6 9

43/54

43/54

1 0 1 A

4 H 0 0 6

43/56

43/56

A

4 H 0 1 1

43/78

43/78

C

B

A

B

43/80

1 0 2

43/80

1 0 2

43/828

C O 7 C 211/52

C O 7 D 213/81

C O 7 C 211/52

C O 7 D 213/81

213/82

231/14

239/28

261/18

275/03

277/56

285/06

307/68

333/38

333/40

213/82

231/14

239/28

261/18

277/56

285/06

307/68

333/38

333/40

A O 1 N 43/82

C O 7 D 275/02

1 0 2

(72)発明者 瀬尾 明

和歌山県橋本市紀見ヶ丘2-3-19

(72)発明者 森本 雅之

大阪府河内長野市西之山町1-28-305

(72)発明者 竹元 剛

大阪府河内長野市西之山町1-28-402

(72)発明者 藤岡 伸祐

大阪府河内長野市上原町474-1-103

F ターム(参考) 4C023 HA02 HA04  
4C033 AA04 AA08 AD08 AD09 AD10  
4C036 AD04 AD16 AD18 AD23 AD27  
AD28  
4C037 MA02  
4C055 AA01 BA01 BA02 BA03 BA05  
BA06 BA39 BA58 BB04 BB07  
CA02 CA03 CA06 CA13 CA34  
CA39 CB04 CB07 DA01 DA06  
DA13  
4C056 AA01 AB01 AC01 AD01 AE03  
AF04  
4C069 AC06 AC07  
4H006 AA01  
4H011 AA01 AC01 AC04 BB08 BB09  
BB10 DA02 DA15 DA16 DD03